

(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2003 年8 月28 日 (28.08.2003)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 03/070754 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07K 5/12, C12N 9/99, A61K 38/00, A61P 17/00, 31/00, 35/00, 37/00, 43/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP03/01859

(22) 国際出願日:

2003年2月20日(20.02.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2002-44000 2002年2月20日(20.02.2002) J

(71) 出願人 および

- (72) 発明者: 吉田 稔 (YOSHIDA,Minoru) [JP/JP]; 〒334-0059 埼玉県 川口市 安行 6 5 5 2 1 Saitama (JP). 西野 憲和 (NISHINO,Norikazu) [JP/JP]; 〒808-0104 福岡県 北九州市 若松区畠田 1 6 6 Fukuoka (JP). 堀之内末治 (HORINOUCHI,Sueharu) [JP/JP]; 〒135-0044東京都 江東区 越中島 1 3 1 6 4 0 3 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 清水 初志, 外(SHIMIZU,Hatsushi et al.); 〒 300-0847 茨城県 土浦市 卸町 1 1 1 関鉄つくばビル 6 階 Ibaraki (JP).

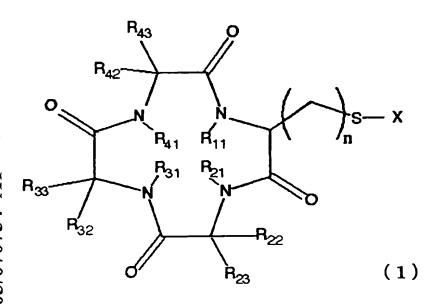
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

-- 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

- (54) Title: HISTONE DEACETYLASE INHIBITORS AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME
- (54) 発明の名称: ヒストン脱アセチル化酵素阻害剤およびその製造方法



(57) Abstract: Compounds represented by the following general formula (1) have a potent activity of selectively inhibiting HDAC1,4. Thus, these compounds are useful as drugs for preventing or treating diseases caused by HDAC1,4. (1)

O 03/070754 A1

A. CLASS Int.	CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07K5/12, C12N9/99, A61K38/00, A61P17/00, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/00, A61P43/00				
According to	o International Patent Classification (IPC) or to both nat	tional classification and IPC			
B. FIELDS	S SEARCHED				
Int.	Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl ⁷ C07K5/12, C12N9/99, A61K38/00, A61P17/00, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/00, A61P43/00				
	ion searched other than minimum documentation to the	·			
Electronic d REGI	ata base consulted during the international search (name STRY (STN), CA (STN)	e of data base and, where practicable, sear	rch terms used)		
C. DOCUI	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where app		Relevant to claim No.		
A	WO 01/07042 A1 (MERCK & CO., 01 February, 2001 (01.02.01), & EP 1204411 A1 & JP	INC.), 2003-505417 A	1-9		
A	COLETTI S.L. et al., Broad spectrum antiprotozoal agents that inhibit histone deacetylase: structure-activity relationships of apicidin. Part 2. Bioorg.Med.Chem.Lett. 2001, Vol.11, No.2, pages 113 to 117		1-9		
A	COLETTI S.L. et al., Design a histone deacetylase inhibitor of apicidin transition state Tetrahedron Letters 2000, Vol pages 7837 to 7841	1-9			
× Furth	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.			
-		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art document member of the same patent family Date of mailing of the international search report 01 April, 2003 (01.04.03)			
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer			
Facsimile No.		Telephone No.			

INTERNATION SEARCH REPORT

	citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Category* A	MEINKE P.T. et al., Synthesis of side chain modified apicidin derivatives: potent mechanism-based histone deacetylase inhibitors. Tetrahedron Letters 2000, Vol.41, No.41, pages 7831 to 7835	1-9
A	<pre>JP 2001-316283 A (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.), 13 November, 2001 (13.11.01), & CA 2317003 A1</pre>	1-9
A	WO 00/52033 A1 (JAPAN ENERGY CORP.), 08 September, 2000 (08.09.00), & EP 1174438 A1 & US 2002/0120099 A1 & JP 2000-256397 A	1-9
A	WO 00/21979 A1 (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.), 20 April, 2000 (20.04.00), & EP 1123309 A2 & JP 2002-527449 A	1-9
		·

	国際調査	国際出願番号 T/JP03	/01859
	する分野の分類(国際特許分類(IPC)) 7K 5/12,C12N 9/99, A61K 38/00,A61P 17/00, A61P	31/00, A61P 35/00, A61P 37/00, A61P	P 43/00
B. 調査を行	った分野		
	小限資料(国際特許分類(IPC)) 7K 5/12, C12N 9/99, A61K 38/00, A61P 17/00, A61P	31/00, A61P 35/00, A61P 37/00, A61	P 43/00
最小限資料以外	の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
	lした電子データベース (データベースの名称、調査 RY (STN) , CA (STN)	に使用した用語)	
C. 関連する	と認められる文献		関連する
引用文献の カテゴリー*	カー・カー・オー・オーン・ロー・オーン・ロー・ストン・スクリカー・ストン・カー・オー・オー・オー・オー・オーン・ロー・ストン・スクリカー・スクリカー・スクリー・スクリー・スクリー・スクリー・スクリー・スクリー・スクリー・スクリ		請求の範囲の番号
A	WO 01/07042 A1 (MERCK &CO., INC.) 2001. & EP 1204411 A1 & JP 2003-505417 A		1-9
A	COLETTI S. L. et al, Broad spectrum ant inhibit histone deacetylase: structur of apicidin. Part 2. Bioorg. Med. Chem. Lett. 2001, Vol. 11, No.	e-activity relationships	1-9
区欄の続	とにも文献が列挙されている。		」 川紙を参照。
* 引用文献 「A」特に関 もの 「E」国際出 以後先を 「L」優先権 日若し	のカテゴリー 車のある文献ではなく、一般的技術水準を示す 「** 頭日前の出願または特許であるが、国際出願日 公表されたもの 「!	の日の後に公表された文献 「「国際出願日又は優先日後に公表 出願と矛盾するものではなく、 の理解のために引用するもの X」特に関連のある文献であって、 の新規性又は進歩性がないと考 Y」特に関連のある文献であって、 上の文献との、当業者にとって よって進歩性がないと考えられ	発明の原理又は理論 当該文献のみで発明 えられるもの 当該文献と他の1以 自明である組合せに

国際調査を完了した日

14.03.03

国際調査報告の発送日

01.04.03

4 N

国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

特許庁審査官(権限のある職員) 冨永 みどり

「&」同一パテントファミリー文献

電話番号 03-3581-1101 内線 3448

9152

/	.*	国际调宜软币	·
1	C (続き) .	関連すると認められる文献	887±
	引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	A	COLETTI S. L. et al, Design and synthesis of histone deacetylase inhibitors: the development of apicidin transition state analogs. Tetrahedron Letters 2000, Vol. 41, No. 41, p. 7837-7841	1-9
	A	MEINKE P.T. et al, Synthesis of side chain modified apicidin derivatives: potent mechanism-based histone deacetylase inhibitors. Tetrahedron Letters 2000, Vol. 41, No. 41, p. 7831-7835	1-9
	A	JP 2001-316283 A(藤沢薬品工業株式会社)2001.11.13 & CA 2317003 A1	1-9
	A	WO 00/52033 A1 (JAPAN ENERGY CORP.) 2000. 09. 08 & EP 1174438 A1 & US 2002/0120099 A1 & JP 2000-256397 A	1-9
	A	WO 00/21979 A1 (藤沢薬品工業株式会社) 2000. 04. 20 & EP1123309 A2 & JP 2002-527449 A	1-9
	,		
١		·	